

Translation

TENT COOPERATION TREATY

PCT/EP2003/014274



PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference 0000054152	FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)	
International application No. PCT/EP2003/014274	International filing date (<i>day/month/year</i>) 16 December 2003 (16.12.2003)	Priority date (<i>day/month/year</i>) 18 December 2002 (18.12.2002)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D 251/70		
Applicant BASF AKTIENGESELLSCHAFT		

1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.
2. This REPORT consists of a total of <u>4</u> sheets, including this cover sheet. <input type="checkbox"/> This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT). These annexes consist of a total of _____ sheets.
3. This report contains indications relating to the following items: I <input checked="" type="checkbox"/> Basis of the report II <input type="checkbox"/> Priority III <input type="checkbox"/> Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability IV <input type="checkbox"/> Lack of unity of invention V <input checked="" type="checkbox"/> Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement VI <input type="checkbox"/> Certain documents cited VII <input type="checkbox"/> Certain defects in the international application VIII <input type="checkbox"/> Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 03 June 2004 (03.06.2004)	Date of completion of this report 18 March 2005 (18.03.2005)
Name and mailing address of the IPEA/EP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International Application No.

PCT/EP2003/014274

I. Basis of the report

1. With regard to the elements of the international application:*

- ☒ the international application as originally filed
- ☒ the description:
pages _____ 1-12 _____, as originally filed
pages _____, filed with the demand
pages _____, filed with the letter of _____
- ☒ the claims:
pages _____ 1-10 _____, as originally filed
pages _____, as amended (together with any statement under Article 19
pages _____, filed with the demand
pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the drawings:
pages _____, as originally filed
pages _____, filed with the demand
pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the sequence listing part of the description:
pages _____, as originally filed
pages _____, filed with the demand
pages _____, filed with the letter of _____

2. With regard to the language, all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in which the international application was filed, unless otherwise indicated under this item.

These elements were available or furnished to this Authority in the following language _____ which is:

- ☐ the language of a translation furnished for the purposes of international search (under Rule 23.1(b)).
- ☐ the language of publication of the international application (under Rule 48.3(b)).
- ☐ the language of the translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55.2 and/or 55.3).

3. With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, the international preliminary examination was carried out on the basis of the sequence listing:

- ☐ contained in the international application in written form.
- ☐ filed together with the international application in computer readable form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in written form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in computer readable form.
- ☐ The statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished.
- ☐ The statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished.

4. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages _____
- ☐ the claims, Nos. _____
- ☐ the drawings, sheets/fig _____

5. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).**

* Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report since they do not contain amendments (Rule 70.16 and 70.17).

** Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International Application No.

PCT/EP 83/14274

V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement**1. Statement**

Novelty (N)	Claims	1-10	YES
	Claims		NO
Inventive step (IS)	Claims		YES
	Claims	1-10	NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-10	YES
	Claims		NO

2. Citations and explanations

The following documents are regarded as relevant prior art:

- (A) EP 0624577
- (B) J. Am. Chem. Soc. 1983, 105, 7592-7604
- (C) DE 92535

Novelty

Owing to the use of cyclic carbonic acid esters of formula III the claimed process appears to meet the requirement of PCT Article 33(2) in the light of the prior art cited above.

Inventive step

The problem addressed by the present invention is seen as that of providing an improved process for producing alkoxy carbonyl aminotriazines.

Document (A) is considered to be the closest prior art. The claimed process differs from that disclosed in (A) in that the carbonic acid esters are cyclic, or at least predominantly so. Document (A) specifically describes (see column 8) a reaction with acyclic carbonic acid esters, although according to column 9 these can only be formed *in situ*. In columns 9 and 10 of document (A) various possible reactions are listed, including the reaction of cyclic carbonic acid esters with a

base and a corresponding alcohol (see method (b) in column 9 and the literature citations provided), which involves precisely the same reaction conditions as specified in the present invention. Document (A) also states (column 12) that an exchange reaction may take place not only between the carbonate and the base but also between the carbonate and the solvent, particularly if the solvent is an ester or an alcohol. In addition to C₁₋₆OH, document (A) also mentions ethylene glycol, propylene glycol and other divalent alcohols as preferred alcohols that can produce the claimed cyclic carbonic acid esters in an exchange reaction. For a person skilled in the art it is obvious from this not only that the desired reaction would also work with cyclic carbonic acid esters but also that, if one were looking for alternative reaction conditions, the reaction could also be carried out with (for example) cyclic carbonic acid esters in order to obtain open-chain derivatives *in situ*. Hence it would only be possible to acknowledge an inventive step (PCT Article 33(3)) if the claimed process were seen to offer an unexpected improvement in comparison with the closest prior art. Currently there is no evidence of any such improvement.

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

REC'D 21 MAR 2005

WIPO

PCT

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000054152	WEITERES VORGEHEN siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/PEA/416)	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP 03/14274	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 16.12.2003	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 18.12.2002
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C07D251/70		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT		

1. Dieser internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.



2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 4 Blätter einschließlich dieses Deckblatts..

☐ Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT).

Diese Anlagen umfassen insgesamt Blätter.

3. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:

- I ☒ Grundlage des Bescheids
- II ☐ Priorität
- III ☐ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
- IV ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
- V ☒ Begründete Feststellung nach Regel 66.2 a)ii) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- VI ☐ Bestimmte angeführte Unterlagen
- VII ☐ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
- VIII ☐ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags 03.06.2004	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 18.03.2005
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tlx 523656 epmu d. Fax: +49 89 2399 - 4465	Bevollmächtigter Bediensteter Hanisch, I Tel. +49 89 2399-7880 

I. Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der **Bestandteile** der internationalen Anmeldung (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt, weil sie keine Änderungen enthalten (Regeln 70.16 und 70.17)*):

Beschreibung, Seiten

1-12 in der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-10 in der ursprünglich eingereichten Fassung

2. Hinsichtlich der **Sprache**: Alle vorstehend genannten Bestandteile standen der Behörde in der Sprache, in der die internationale Anmeldung eingereicht worden ist, zur Verfügung oder wurden in dieser eingereicht, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

Die Bestandteile standen der Behörde in der Sprache: zur Verfügung bzw. wurden in dieser Sprache eingereicht; dabei handelt es sich um:

- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (nach Regel 23.1(b)).
 - ☐ die Veröffentlichungssprache der internationalen Anmeldung (nach Regel 48.3(b)).
 - ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen vorläufigen Prüfung eingereicht worden ist (nach Regel 55.2 und/oder 55.3).
3. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale vorläufige Prüfung auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das:
- ☐ in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.
 - ☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
 - ☐ bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.
 - ☐ bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
 - ☐ Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.
 - ☐ Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfassten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.
4. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:
- ☐ Beschreibung, Seiten:
 - ☐ Ansprüche, Nr.:
 - ☐ Zeichnungen, Blatt:
5. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)).

(Auf Ersatzblätter, die solche Änderungen enthalten, ist unter Punkt 1 hinzuweisen; sie sind diesem Bericht beizufügen.)

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER
PRÜFUNGSBERICHT**

Internationales Aktenzeichen PCT/EP 03/14274

6. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

- | | |
|--------------------------------|----------------------|
| 1. Feststellung | |
| Neuheit (N) | Ja: Ansprüche 1-10 |
| | Nein: Ansprüche |
| Erfinderische Tätigkeit (IS) | Ja: Ansprüche |
| | Nein: Ansprüche 1-10 |
| Gewerbliche Anwendbarkeit (IA) | Ja: Ansprüche: 1-10 |
| | Nein: Ansprüche: |

2. Unterlagen und Erklärungen:

siehe Beiblatt

Zu Punkt V.

Als relevanter Stand der Technik werden folgende Dokumente angesehen:

- (A) EP 0624577
- (B) J. Am. Chem. Soc. 1983, 105, 7592-7604
- (C) DE 92535

Neuheit

Das vorliegende Verfahren scheint im Lichte des obigen Stands der Technik durch die Verwendung von cyclischen Kohlensäureestern der Formel III die Erfordernisse von Artikel 33(2) PCT zu erfüllen.

Erfinderische Tätigkeit

Die Aufgabe der vorliegenden Anmeldung wird darin gesehen, ein verbessertes Verfahren zur Herstellung von Alkoxycarbonylaminotriazinen bereitzustellen.

(A) wird als der nächste Stand der Technik angesehen. Das vorliegende Verfahren unterscheidet sich von dem in (A) offenbarten dadurch, daß die verwendeten Kohlensäureester - zumindest vorwiegend - cyclisch sind. (A) beschreibt in Spalte 8 die Umsetzung ausdrücklich mit acyclischen Kohlensäureestern, die nach Spalte 9 jedoch auch erst in situ gebildet werden können. Hierfür gibt (A) in den Spalten 9 und 10 verschiedene Reaktionsmöglichkeiten an, u.a. unter Punkt (b) die Umsetzung von cyclischen Kohlensäureestern mit Base und einem entsprechenden Alkohol (siehe die unter (b) zitierten Literaturstellen), also genau die Reaktionsbedingungen der vorliegenden Anmeldung. Zudem verweist (A) in Spalte 12 darauf, dass das Carbonat nicht nur mit der verwendeten Base eine Austauschreaktion eingehen kann, sondern auch mit dem Lösungsmittel, insbesondere, wenn es sich hierbei um Ester oder Alkohol handelt. Als bevorzugte Alkohole werden neben $C_{1-6}OH$ Ethylenglykol, Propylenglykol und weitere zweiwertige Alkohole genannt, die in einer Austauschreaktion zu den vorliegenden zyklischen Kohlensäureestern führen können. Für den Fachmann lag es aufgrund dieser Hinweise nicht nur nahe, dass die gewünschte Reaktion auch mit cyclischem Kohlensäureestern ablaufen würde, sondern, wenn er auf der Suche nach alternativen Reaktionsbedingungen ist, auch, die Reaktion z.B. mit cyclischen Kohlensäureestern durchzuführen, um in situ die offenkettigen Derivate zu erhalten. Eine erfinderische Tätigkeit im Sinne von Artikel 33(3) PCT könnte deshalb nur dann gegeben sein, wenn mit dem vorliegenden Verfahren eine gegenüber dem nächsten Stand der Technik unerwartete Verbesserung erzielt wird. Eine solche ist jedoch derzeit nicht ersichtlich.